

DIALOG(R) File 347:JAPIO
(c) 2003 JPO & JAPIO. All rts. reserv.

MEDICINE FOR EXTERNAL USE IN TREATING BED SORE AND SKIN ULCER

PUB. NO.: 04-208219 [JP 4208219 A]
PUBLISHED: July 29, 1992 (19920729)
INVENTOR(s): ABE TAKEO
EBIZUKA SHIGEO
APPLICANT(s): HINOKI SHINYAKU KK [359719] (A Japanese Company or
Corporation), JP (Japan)
APPL. NO.: 02-200063 [JP 90200063]
FILED: July 26, 1990 (19900726)
INTL CLASS: [5] A61K-031/12; A61K-031/025; A61K-031/415
JAPIO CLASS: 14.4 (ORGANIC CHEMISTRY -- Medicine)
JOURNAL: Section: C, Section No. 1004, Vol. 16, No. 544, Pg. 153,
November 13, 1992 (19921113)

ABSTRACT

PURPOSE: To obtain the subject medicine for external use, excellent in its effects without requiring a fear of generating resistant bacteria by blending hinokitiol or its derivative with other ingredients.

CONSTITUTION: The subject medicine is obtained by blending 0.1-5% hinokitiol or its derivative as a principal ingredient with other ingredients. Blood circulation in the skin is promoted with the hinokitiol to supply blood to the bed sore or ulcerated parts. Furthermore, bacterial contamination in the bed sore or ulcerated parts is improved by sterilizing action of the hinokitiol to prevent the resistant bacteria from appearing. An antiulcer agent such as allantoin or azulene is preferably used together with the aforementioned medicine for the external use.

⑫ 公開特許公報 (A)

平4-208219

⑬ Int. Cl. 5

A 61 K 31/12
31/025
31/415

識別記号

ADA
ADZ

府内整理番号

8413-4C
8413-4C
7475-4C

⑭ 公開 平成4年(1992)7月29日

審査請求 未請求 請求項の数 3 (全3頁)

⑮ 発明の名称 梅毒及び皮膚潰瘍治療外用剤

⑯ 特 願 平2-200063

⑰ 出 願 平2(1990)7月26日

⑱ 発明者 阿部 武夫 東京都中央区日本橋本町2丁目4番5号 ヒノキ新薬株式会社内

⑲ 発明者 海老塚 重夫 東京都狛江市和泉本町1丁目7番12号 株式会社肌粧品科学開放研究所内

⑳ 出願人 ヒノキ新薬株式会社 東京都中央区日本橋本町2丁目4番5号

㉑ 代理人 弁理士 稲木 次之 外1名

日月 系田

いる。

1. 発明の名称

梅毒及び皮膚潰瘍治療外用剤

梅毒が進行すると水泡形成を経て潰瘍となることがあります、悪い場合には潰瘍が骨に達する場合もある。

2. 特許請求の範囲

- (1) ヒノキテオール又はその誘導体を配合したことを特徴とする梅毒及び皮膚潰瘍治療外用剤。
- (2) ヒノキテオール又はその誘導体を0.1~5.0%含有することを特徴とする請求項1記載の梅毒及び皮膚潰瘍治療外用剤。
- (3) アラントイン、アズレン等の抗潰瘍剤を併用したことを特徴とする請求項1記載の梅毒及び皮膚潰瘍治療外用剤。

3. 発明の詳細な説明

産業上の利用分野

本発明は、ヒノキテールを主成分として配合した梅毒及び皮膚潰瘍治療用の外用剤に関するものである。

梅毒は俗称床ずれとも呼ばれ、これは持続的圧迫により虚血性変化が起き、その状態が長時間続くことにより発生する皮下組織の壞死といわれて

従来技術

従来の梅毒の外用療法としては、ポリエチレングリコールからなるマクロゴール基剤に抗生物質(アミノ配糖体系及びペニシリン系)などの薬剤を配合したものやイソジンシュガー(ポビドンヨードと白糖を組み合わせた)等の製剤を使用した軟膏剤塗布療法が行なわれている。

発明が解決しようとする課題

しかしながら、抗生物質を外用剤に用いた場合は、使用量が多くなる傾向があり、この為耐性菌を出現させてしまうことが知られている。

さらにイソジンシュガー製剤は抗生物質をあまり多用しない点が長所ではあるが、満足のいく治療効果が得られにくく、他の治療法との併用も行なわれているのが現状である。

皮膚潰瘍も原因の如何を問わず大体組織の壞死

によるもので、その治療法は梅毒と共に通することが多い。その為抗潰瘍剤を配合した外用剤を使用する場合には、抗生物質の併用が必要となる。しかし、抗生物質を使用すると細菌が耐性化してしまう傾向になり、その使用はあまり好ましくないとされている。

そこで本発明者達は、かかる問題点を解消すべく鋭意研究した結果本発明を見出し発明したものである。

問題点を解決するための手段

すなわち本発明は、薬剤としてヒノキチオールを主成分とした外用剤により梅毒及び皮膚潰瘍の治療することを目的する。

尚、配合するヒノキチオールの量は、0.1~5.0%の範囲が適当であり、0.1%以下の場合は充分な治療及び殺菌効果が見られず、また5.0%以上の時には治療効果に優位な差が認められない。

本発明の外用剤の態様としては、水溶性軟膏、油脂性軟膏、ローション、オイル、ゲル剤、パウダー等が挙げられる。

-3-

2重量%含有させたものを作成し、梅毒20症例及び梅毒以外による皮膚潰瘍(熱傷潰瘍、外傷性潰瘍など)20症例について、梅毒又は潰瘍部に軟膏を毎日塗布した場合の治療効果について経時的観察を行なった。

その結果は、表-1及び表-2に示す通りとなつた。

梅毒に対する総合評価 表-1

評価時期	極めて有効	有効	やや有効	不变	悪化	合計
1週	0	3	9	6	2	20
2週	2	4	8	3	3	20
4週	3	7	5	2	1	18
6週	4	9	3	1	0	17
最終	4	9	3	1	3	20

皮膚潰瘍に対する総合評価 表-2

評価時期	極めて有効	有効	やや有効	不变	悪化	合計
1週	1	4	10	3	2	20
2週	2	6	7	1	4	20
4週	5	7	4	0	2	18
6週	7	7	2	0	1	17
最終	7	7	2	0	4	20

水溶性基剤としてはマクロゴール基剤、油脂性軟膏としてはワセリン基剤、オイルとしてはオリーブ油、ゴマ油、ツバキ油等の植物油、ゲルとしてはカルボキシビニルポリマー、ポリアクリル酸ナトリウム、パウダーとしては重鉛華、タルク等が代表的な基剤として挙げられる。

本発明にかかる外用剤では、その他にアラントイン、グアイアズレン等の抗潰瘍剤を使用すると良い。

作 用

外用剤に含まれるヒノキチオールにより皮膚の血行を促進することにより、梅毒又は潰瘍部に血液が供給されることになる。

またヒノキチオールが殺菌作用を有するため皮膚の梅毒部及び潰瘍部での細菌汚染を改善し、耐性菌を出現させないように作用する。

以下に本発明を具体的な実施例に従って詳細に説明する。

実施例-1

ワセリンを基剤とする軟膏にヒノキチオールを

-4-

但し、症例20に対して合計が20に満たないものは、症状が悪化したために、投与を中止したものである。

以上の結果、梅毒の場合の有効性は65%以上、皮膚潰瘍の場合の有効性は70%あった。

実施例-2

ヒノキチオールを3重量%含有させたマクロゴール軟膏剤を作成し、梅毒30症例について無作為に15例づつに分け、その有効性を調べた。

その結果は、表-3及び表-4に示す通りとなつた。

尚比較例として、白糖310gとイソジンゲル(ボビドンヨード)90gとイソジン液28mlとを混合することにより作成したイソジンシュガーソフト剤を用いて比較した。

ヒノキチオールを含有させた軟膏剤の梅毒に対する総合評価 表-3

評価時期	極めて有効	有効	やや有効	不变	悪化	合計
1週	0	3	7	3	2	15
2週	2	4	5	1	3	15
4週	4	6	1	1	1	13
最終	4	6	1	1	3	15

白糖とポビドンヨードを含有した製剤の褥瘡に対する総合評価 表-4

評価時期	極めて有効	有効	やや有効	不变	悪化	合計
1週	0	1	7	5	2	15
2週	1	2	6	3	3	15
4週	2	5	3	2	1	13
最終	2	5	3	2	3	15

但し、症例 15 に対して合計が 15 に満たないものは、症状が悪化したために、投与を中止したものである。

以上の通りヒノキチオールを含有させた軟膏剤が有効性 66.7% 以上に対して、白糖とポビドンヨードを含有させたものは、46.7% と低かった。

実施例-3

以下の配合量からなるゲル剤を作成し、このゲル剤の褥瘡に対する有効性に関して、20症例について調べた。その結果は表-5 に示す通りとなった。

ヒノキチオールのナトリウム塩	0.7%
カルボキシビニルポリマー	0.5%
水酸化カリウム	0.3%

1,3ブチレングリコール	10.0%
精製水	88.5%

ゲル剤の褥瘡に対する総合評価 表-5

評価時期	極めて有効	有効	やや有効	不变	悪化	合計
1週	0	2	9	8	1	20
2週	1	4	8	5	2	20
4週	3	9	4	2	1	19
最終	3	9	4	2	2	20

以上の通りヒノキチオールのナトリウム塩を含有させたゲル剤は、その有効性が 60.0% と高かった。

効 果

以上述べたように本発明の褥瘡及び皮膚潰瘍用の外用剤は、従来の外用剤に比較して、その効果が優れており、また主成分のヒノキチオールが殺菌性を有していることから、耐性菌の発生を心配する必要がない。

特許出願人 ヒノキ新薬株式会社
代理人弁理士 稲木 次之
代理人弁理士 押本 勲彦